

ІНСТРУКЦІЯ для медичного застосування лікарського засобу

АСПЕКАРД

Склад:

діюча речовина: acetylsalicylic acid;

1 таблетка містить кислоти ацетилсаліцилової 0,1 г (100 мг);

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна, натрію кроскармеллозакремнію діоксид колоїдний безводний, кислота стеаринова.

Лікарська форма. Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки білого кольору, верхня і нижня поверхні яких плоскі, краї поверхонь скошені.

Фармакотерапевтична група. Антитромботичні засоби.

Код АТХ В01А С06.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Ацетилсаліцилова кислота пригнічує агрегацію тромбоцитів шляхом блокування синтезу тромбоксану. Механізм її дії полягає у необоротній інактивації ферменту циклооксигенази (ЦОГ-1). Зазначений інгібуючий ефект особливо виражений для тромбоцитів, оскільки вони не здатні до ресинтезу вказаного ферменту. Ацетилсаліцилова кислота виявляє й інші інгібуючі ефекти на тромбоцити. Завдяки зазначеним ефектам її можна застосовують при багатьох васкулярних захворюваннях.

Ацетилсаліцилова кислота належить до групи нестероїдних протизапальних лікарських засобів (НПЗЗ) з анальгетичними, жарознижувальними і протизапальними властивостями. Перорально у більш високих дозах ацетилсаліцилову кислоту слід застосовувати для полегшення болю та при легких фібрильних станах, таких як застуда та грип, для зниження температури і послаблення болю у суглобах і м'язах, при гострих та хронічних запальних захворюваннях, таких як ревматоїдний артрит, остеоартрит та анкілозуючий спондиліт.

Фармакокінетика.

Саліцилова кислота та її метаболіти виводяться з організму переважно нирками.

У ході досліджень на тваринах саліцилати при високих дозах спричиняли ураження нирок і не призводили до жодних інших органічних уражень.

Ацетилсаліцилова кислота широко вивчалася *in vitro* та *in vivo* на мутагенність, проте не було виявлено відповідних доказів наявності мутагенного потенціалу. Те ж саме стосується досліджень канцерогенності.

Саліцилати виявляли тератогенний вплив у ході досліджень на різних видах тварин.

Були описані порушення імплантації, ембріотоксичний і фітотоксичний ефекти та порушення здатності до навчання у потомства після застосування препарату у пренатальний період.

Клінічні характеристики.

Показання.

Для зниження ризику:

- смерті у пацієнтів з підозрою на гострий інфаркт міокарда;
- захворюваності і смерті у пацієнтів, які перенесли інфаркт міокарда;
- транзиторних ішемічних атак (ТІА) та інсульту у пацієнтів з ТІА;
- захворюваності і смерті при стабільній і нестабільній стенокардії;

-інфаркту міокарда у пацієнтів з високим ризиком розвитку серцево-судинних ускладнень (цукровий діабет, контрольована артеріальна гіпертензія) та у хворих із багатofакторним ризиком серцево-судинних захворювань (гіперліпідемія, ожиріння, тютюнопаління, літній вік).

Для профілактики:

-тромбозів і емболій після операцій на судинах (черезшкірна транслюмінарна катетерна ангіопластика (РТСА), ендартеректомія сонної артерії, аортокоронарне шунтування (САВГ), артеріовенозне шунтування);
-тромбозу глибоких вен і емболій легеневої артерії після довготривалої іммобілізації (після хірургічних операцій).

Для вторинної профілактики інсульту.

Противопоказання.

-Гіперчутливість до ацетилсаліцилової кислоти, інших саліцилатів або до будь-якого компонента препарату.
-Астма, спричинена застосуванням саліцилатів або речовин з подібною дією, особливо НПЗЗ, в анамнезі.
-Гострі пептичні виразки.
-Геморагічний діатез.
-Ниркова недостатність тяжкого ступеня.
-Печінкова недостатність тяжкого ступеня.
-Серцева недостатність тяжкого ступеня.
-Комбінація з метотрексатом у дозуванні 15 мг/тиждень або більше підвищує гематологічну токсичність метотрексату (зниження ниркового кліренсу метотрексату протизапальними агентами і витіснення саліцилатами метотрексату зі зв'язку з протеїнами плазми).
-III триместр вагітності застосування протипоказано.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Противопоказання для одночасного застосування.

Застосування ацетилсаліцилової кислоти та метотрексату в дозах 15 мг/тиждень і більше підвищує гематологічну токсичність метотрексату (зниження ниркового кліренсу метотрексату протизапальними агентами і витіснення саліцилатами метотрексату зі зв'язку з протеїнами плазми).

Комбінації, які потрібно застосовувати з обережністю

При застосуванні ацетилсаліцилової кислоти та метотрексату в дозах менше 15 мг/тиждень підвищується гематологічна токсичність метотрексату (зниження ниркового кліренсу метотрексату протизапальними агентами і витіснення саліцилатами метотрексату зі зв'язку з протеїнами плазми).

Одночасне застосування ацетилсаліцилової кислоти з ібупрофеном перешкоджає необоротному інгібуванню тромбоцитів ацетилсаліциловою кислотою. Лікування ібупрофеном пацієнтів з ризиком кардіоваскулярних захворювань може обмежувати кардіопротекторну дію ацетилсаліцилової кислоти. При одночасному застосуванні ацетилсаліцилової кислоти та антикоагулянтів, тромболітиків, та інших інгібіторів агрегації тромбоцитів або інгібіторів гемостазу підвищується ризик кровотечі.

При одночасному застосуванні високих доз саліцилатів із НПЗЗ (через взаємопосилувальний ефект) підвищується ризик виникнення виразок і шлунково-кишкових кровотеч.

При застосуванні із селективними інгібіторами зворотного захоплення серотоніну підвищується ризик розвитку шлунково-кишкової кровотечі внаслідок можливого ефекту синергізму.

При одночасному застосуванні з дигоксином концентрація останнього у плазмі підвищується внаслідок зниження ниркової екскреції.

При одночасному застосуванні високих доз ацетилсаліцилової кислоти та антидіабетичних препаратів групи похідних сульфонілсечовини посилюється гіпоглікемічний ефект останніх за рахунок витіснення сульфонілсечовини, зв'язаної з протеїнами плазми, ацетилсаліциловою кислотою.

Діуретики у комбінації з високими дозами ацетилсаліцилової кислоти знижують клубочкову фільтрацію завдяки зниженню синтезу простагландинів у нирках.

Системні глюкокортикостероїди (за винятком гідрокортизону, який застосовують для замісної терапії при хворобі Аддісона) знижують рівень саліцилатів у крові та підвищують ризик передозування після закінчення лікування глюкокортикостероїдами.

Ангіотензинперетворювальні ферменти (АПФ) у комбінації з високими дозами ацетилсаліцилової кислоти спричиняють зниження фільтрації в клубочках внаслідок інгібування вазодилататорного ефекту простагландинів та зниження антигіпертензивного ефекту.

При одночасному застосуванні з вальпроєвою кислотою ацетилсаліцилова кислота витісняє її зі зв'язку з протеїнами плазми, підвищуючи токсичність останньої.

Алкоголь сприяє пошкодженню слизової оболонки шлунково-кишкового тракту і пролонгує час кровотечі внаслідок синергізму ацетилсаліцилової кислоти та алкоголю.

Одночасне застосування з урикозуричними засобами, такими як бензобромарон, пробенецид, знижує ефект виведення сечової кислоти (внаслідок конкуренції виведення сечової кислоти нирковими канальцями).

Особливості застосування.

Ацетилсаліцилову кислоту застосовують з обережністю у разі:

-гіперчутливості до аналгетичних, протизапальних, протиревматичних засобів, а також при наявності алергії на інші речовини;

-виразок шлунково-кишкового тракту, включаючи хронічні та рекурентні виразки або шлунково-кишкові кровотечі в анамнезі;

-одночасного застосування антикоагулянтів;

-порушень функції нирок або порушень серцево-судинного кровообігу (таких як патологія судин нирки, застійна серцева недостатність, гіповолемія, обширні операції, сепсис або сильні кровотечі), оскільки ацетилсаліцилова кислота може також збільшити ризик порушення функції нирок та гострої ниркової недостатності;

-тяжкої недостатності глюкозо-6-фосфатдегідрогенази, оскільки ацетилсаліцилова кислота може спричинити гемоліз або гемолітичну анемію, особливо за наявності факторів, які можуть збільшити ризик гемолізу, таких як високі дози препарату, гарячка або інфекційний процес;

-порушення функції печінки.

Ібупрофен може зменшити інгібіторний ефект ацетилсаліцилової кислоти щодо агрегації тромбоцитів. У разі застосування Аспекарду перед початком прийому ібупрофену як знеболювального засобу пацієнт повинен проконсультуватися з лікарем.

Ацетилсаліцилова кислота може зумовлювати розвиток бронхоспазму або нападу бронхіальної астми чи інші реакції підвищеної чутливості. Фактори ризику включають астму в анамнезі, сінову гарячку, поліпоз носа або хронічне респіраторне захворювання, алергічні реакції (наприклад шкірні реакції, свербіж, кропив'янку) на інші речовини в анамнезі.

Через інгібіторний ефект ацетилсаліцилової кислоти щодо агрегації тромбоцитів, який зберігається упродовж кількох днів після прийому, застосування препаратів, які містять ацетилсаліцилову кислоту, може підвищити імовірність / посилення кровотечі при хірургічних операціях (включаючи незначні хірургічні втручання, наприклад видалення зуба).

При застосуванні малих доз ацетилсаліцилової кислоти може знижуватися виведення сечової кислоти. Це може призвести до нападу подагри у схильних до неї пацієнтів.

Не слід застосовувати препарати, які містять ацетилсаліцилову кислоту, дітям та підліткам із гострою респіраторною вірусною інфекцією (ГРВІ), яка супроводжується або не супроводжується підвищенням температури тіла, без консультації з лікарем. При деяких вірусних захворюваннях, особливо при грипі А, грипі В і вітряній віспі, існує ризик розвитку синдрому Рея, який є дуже рідкісною, але небезпечною для життя хворобою, що потребує невідкладного медичного втручання. Ризик може бути підвищеним, якщо ацетилсаліцилову кислоту застосовують як супутній лікарський засіб, проте причинно-наслідковий зв'язок у цьому випадку не доведений. Якщо вказані стани супроводжуються постійним блюванням, це може бути проявом синдрому Рея.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Пригнічення синтезу простагландинів може негативно вплинути на вагітність та/або ембріональний /внутрішньоутробний розвиток. Наявні дані епідеміологічних досліджень вказують на ризик викидня та вад розвитку плода після застосування інгібіторів синтезу простагландинів на початку вагітності. Ризик підвищується залежно від збільшення дози та тривалості терапії. Згідно з наявними даними, зв'язок між прийомом ацетилсаліцилової кислоти і підвищеним ризиком викидня не підтверджено.

Наявні епідеміологічні дані щодо виникнення вад розвитку не є послідовними, проте підвищений ризик гастрошизису не можна виключати при застосуванні ацетилсаліцилової кислоти. Результати проспективного дослідження впливу на ранньому терміні вагітності (1-4-й місяць) за участю приблизно 14800 пар жінка-дитина не вказують на будь-який зв'язок із підвищеним ризиком розвитку мальформацій. Дослідження ацетилсаліцилової кислоти на тваринах вказують на репродуктивну токсичність.

Під час I і II триместру вагітності препарати, що містять ацетилсаліцилову кислоту, не слід призначати без чіткої клінічної необхідності. Для жінок, які, імовірно можуть бути вагітними, або жінок у I і II триместрах вагітності доза препаратів, які містять ацетилсаліцилову кислоту, повинна бути якомога нижчою, а тривалість лікування якомога коротшою.

Під час III триместру вагітності всі інгібітори синтезу простагландинів можуть впливати на плід таким чином:

- серцево-легенева токсичність (із передчасним закриттям артеріальної протоки і легеневою гіпертензією);
- порушення функції нирок з можливим подальшим розвитком ниркової недостатності з олігогідрамніоном.

На жінку і дитину в кінці вагітності інгібітори синтезу простагландинів можуть впливати таким чином:

- можливість подовження часу кровотечі, антиагрегантний ефект, який може виникнути навіть після дуже низьких доз;
- гальмування скорочень матки, що може призвести до затримки або подовження тривалості пологів.

Зважаючи на це, ацетилсаліцилова кислота протипоказана під час III триместру вагітності.

Саліцилати і їх метаболіти потрапляють у грудне молоко у невеликих кількостях.

Оскільки не було виявлено шкідливого впливу ацетилсаліцилової кислоти на дитину після прийому жінками у період лактації, переривати годування груддю, як правило, не потрібно. Однак у разі регулярного застосування або застосування високих доз годування груддю необхідно припинити на ранніх етапах.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Не відзначалося впливу на здатність керувати автомобілем та іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Препарат приймати внутрішньо за 30-60 хвилин до їди, не розжовуючи, запиваючи достатньою кількістю рідини.

Для зниження ризику смерті пацієнтам із підозрою на гострий інфаркт міокарда застосовувати препарат у дозі 100-300 мг на добу. Упродовж 30 днів після інфаркту міокарду продовжують приймати підтримуючу дозу 100-300 мг на добу.

Через 30 днів слід розглянути питання про подальшу профілактику рецидиву інфаркту міокарда.

Щоб досягти швидкої абсорбції при застосуванні для цього показання, першу таблетку необхідно розжувати.

Для зниження ризику захворювання і летального наслідку пацієнтам, які перенесли інфаркт міокарда, застосовують 100-300 мг на добу.

Для вторинної профілактики інсульту застосовувати препарат у дозі 100-300 мг на добу.

Для зниження ризику ТІА та інсульту пацієнтам з ТІА застосовувати 100-300 мг на добу.

Для зниження ризику розвитку захворювання і летального наслідку пацієнтам зі стабільною і нестабільною стенокардією застосовують 100-300 мг на добу.

Для профілактики тромбоемболії після операцій на судинах (черезшкірна транслюмінарна катетерна ангіопластика (РТСА), ендартеректомія сонної артерії, аортокоронарне шунтування (САВ), артеріовенозне шунтування) застосовувати препарат у дозі 100-200 мг на добу кожного дня або 300 мг на добу через день. Для профілактики тромбозу глибоких вен і емболії легеневої артерії після довготривалого стану іммобілізації (після хірургічних операцій) 100-200 мг на добу або 300 мг на добу через день. Для профілактики інфаркту міокарда пацієнтам з високим ризиком розвитку серцево-судинних ускладнень (цукровий діабет, контрольована артеріальна гіпертензія) та хворим із багатофакторним ризиком серцево-судинних захворювань (гіперліпідемія, ожиріння, тютюнопаління, літній вік) застосовують 100 мг на добу або 300 мг на добу через день.

Діти.

Згідно з показаннями препарат Аспекард не застосовують дітям. Застосування ацетилсаліцилової кислоти дітям віком до 16 років може спричинити тяжкі побічні ефекти (у тому числі синдром Рея, однією з ознак якого є постійне блювання).

Передозування.

Токсична дія саліцилатів можлива у результаті хронічної інтоксикації, що виникла внаслідок тривалої терапії (застосування понад 100 мг/кг/добу більше 2 днів може спричинити токсичні ефекти), у результаті гострої інтоксикації, яка загрожує життю (передозування) і причиною якої може бути, наприклад, випадкове застосування дітям або непередбачене передозування.

Хронічне отруєння саліцилатами може мати прихований характер, оскільки ознаки і симптоми його неспецифічні. Помірна хронічна інтоксикація, спричинена саліцилатами, або саліцилізм, спостерігається, як правило, тільки після повторних прийомів великих доз.

Симптоми. Запаморочення, вертиго, дзвін у вухах, глухота, посилене потовиділення, нудота і блювання, головний біль, сплутаність свідомості. Зазначені дози можна контролювати шляхом зниження дози. Дзвіну вухах можливий при концентрації саліцилатів у плазмі крові вище ніж 150-300 мкг/мл. Серйозніші побічні реакції зустрічаються при концентрації саліцилатів у плазмі крові вище 300 мкг/мл.

Про гостру інтоксикацію свідчить виражена зміна кислотно-лужного балансу, який можваріювати залежно від віку пацієнта і тяжкості інтоксикації. Найчастішим його проявом у дітей є метаболічний ацидоз. Тяжкість стану не можна оцінити лише на підставі концентрації саліцилатів у плазмі. Абсорбція ацетилсаліцилової кислоти може уповільнюватися внаслідок затримки шлункового вивільнення, формування конкрементів у шлунку.

Лікування. Лікування гострої інтоксикації, спричиненої передозуванням ацетилсаліцилової кислоти, визначається ступенем тяжкості, клінічними симптомами і забезпечується стандартними заходами, які проводяться при отруєнні. Усі застосовані заходи повинні бути спрямовані на прискорення видалення препарату та відновлення електролітного і кислотно-лужного балансу.

Прояви і симптоми/результати аналізів внаслідок комплексних патофізіологічних ефектів отруєння саліцилатами/та необхідні терапевтичні заходи:

Прояви і симптоми	Результати аналізів	Терапевтичні заходи
Інтоксикація легкого або середнього ступеня		Промивання шлунка, введення активованого вугілля, форсований лужний діурез
Тахіпноє, гіпервентиляція, респіраторний алкалоз	Алкалемія, алкалурія	Відновлення електролітного і кислотно-лужного балансу
Діафорез (посилене потовиділення)		
Нудота, блювання		

Інтоксикація середнього або тяжкого ступеня		Промивання шлунка, введення активованого вугілля, форсований лужний діурез, гемодіаліз у тяжких випадках
Респіраторний алкалоз із компенсаторним метаболічним ацидозом	Ацидемія, ацидурія	Відновлення електролітного і кислотно-лужного балансу
Гіперпірексія		Відновлення електролітного і кислотно-лужного балансу
Респіраторні: гіпервентиляція, некардіогенний набряк легенів, дихальна недостатність, асфіксія		
Серцево-судинні: дизаритмії, артеріальна гіпотензія, серцево-судинна недостатність	Зміни артеріального тиску, ЕКГ	
Втрата рідини та електролітів: дегідратація, олігурія, ниркова недостатність	Гіпокаліємія, гіпернатріємія, гіпонатріємія, зміни ниркової функції	Відновлення електролітного і кислотно-лужного балансу
Порушення метаболізму глюкози, кетоацидоз	Гіперглікемія, гіпоглікемія (особливо у дітей); підвищений рівень кетонових тіл	
Дзвін у вухах, глухота		
Шлунково-кишкові: кровотеча у ШКТ		
Гематологічні: інгібування тромбоцитів, коагулопатія	Пролонгація часу кровотечі, гіпопротромбінемія	
Неврологічні: токсична енцефалопатія та пригнічення ЦНС з такими проявами, як летаргія, сплутаність свідомості, кома і судоми		

Побічні реакції.

З боку шлункового-тракту розлади: при тривалому застосуванні ацетилсаліцилової кислоти можуть спостерігатися такі прояви як симптоми диспепсії, біль в епігастральній ділянці та абдомінальний біль; запалення шлунково-кишкового тракту, ерозивно-виразкові ураження шлунково-кишкового тракту, які потенційно можуть спричинити шлунково-кишкові геморагії і перфорації з відповідними лабораторними показниками та клінічними проявами.

Внаслідок антиагрегантної дії на тромбоцити ацетилсаліцилова кислота може асоціюватися з ризиком розвитку кровотеч. Спостерігались такі кровотечі, як періопераційні геморагії, гематоми, кровотечі з органів сечостатевої системи, носові кровотечі, кровотечі з ясен; рідко або дуже рідко - серйозні кровотечі, такі як геморагії шлунково-кишкового тракту, церебральні геморагії (особливо в пацієнтів із неконтрольованою гіпертензією та/або при одночасному застосуванні антигемостатичних засобів), які в могли потенційно загрожувати життю.

Геморагії можуть призвести до гострої і хронічної постгеморагічної анемії, залізодефіцитної анемії (внаслідок так званої прихованої мікрокровотечі) з відповідними лабораторними проявами і клінічними симптомами, такими як астенія, блідість шкірного покриву, гіперперфузія.

У пацієнтів з важкими формами недостатності глюкозо-6-фосфат-дегідрогенази виявлено гемоліз та гемолітична анемія при застосуванні ацетилсаліцилової кислоти.

Повідомлялося про порушення функції нирок та розвиток гострої ниркової недостатності.

Реакції підвищеної чутливості з відповідними лабораторними та клінічними проявами включають астматичний стан, шкірні реакції легкого або середнього ступеня, а також реакції з боку респіраторного тракту, шлунково-кишкового тракту та серцево-судинної системи, включаючи такі симптоми, як висипання, кропив'янка, набряки, свербіж, риніт, закладеність носа, серцево-дихальна недостатність і дуже рідко - тяжкі реакції, включаючи анафілактичний шок.

Дуже рідко повідомлялося про транзиторну печінкову недостатність із підвищенням рівня трансаміназ печінки.

Спостерігалися запаморочення і дзвін у вухах, що може свідчити про передозування.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

В оригінальній упаковці при температурі не вище 25°C.

Упаковка.

По 12 таблеток у блістері, по 10 блістерів у пачці з картону;
по 100 таблеток у контейнері в пачці або без пачки.

Категорія відпуску.

Без рецепта.

Виробник.

ТОВ «Стиролбіофарм».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Україна, 84610, Донецька обл., м. Горлівка, вул. Горлівської дивізії, 97.